

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004年12月29日 (29.12.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/113359 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07H 17/02, A61K
31/7056, 31/706, 45/00, C07D 231/02, A61P 3/00, 3/04,
3/06, 3/10, 9/10, 9/12, 13/12, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008695

(22) 国際出願日: 2004年6月15日 (15.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-175663 2003年6月20日 (20.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ
薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL
CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野
1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 菊地 紀彦
(KIKUCHI, Norihiko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南
安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品
工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 藤倉 秀紀
(FUJIKURA, Hideki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南

安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品
工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 田澤 滋
樹 (TAZAWA, Shigeki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南
安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品
工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 大和 徳久
(YAMATO, Tokuhisa) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南
安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工
業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治 正幸
(ISAJI, Masayuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南
安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株
式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

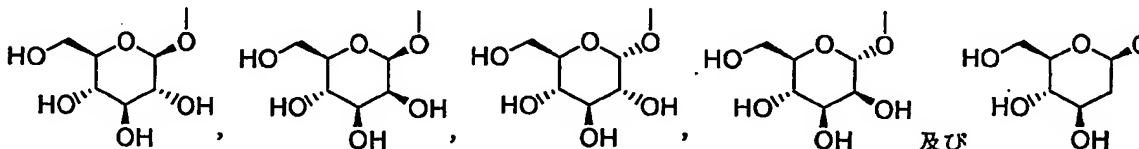
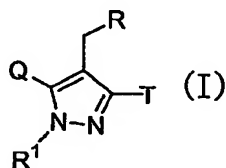
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,

[続葉有]

(54) Title: PYRAZOLE DERIVATIVE, DRUG COMPOSITION CONTAINING THE SAME AND PRODUCTION INTERME-
DIATE THEREFOR

(54) 発明の名称: ピラゾール誘導体、それを含有する医薬組成物及びその製造中間体



(57) Abstract: A pyrazole derivative capable of expressing an excellent human sodium/glucose cotransporter (SGLT) inhibiting activity, which pyrazole derivative is useful as a preventive, progress inhibitor or therapeutic agent for diseases (diabetes mellitus, after-meal hyperglycemia, impaired glucose tolerance, diabetic complications, etc.) attributed to excess introjection of at least one carbohydrate selected from among glucose, fructose and mannose. The pyrazole derivative is represented by the general formula: (I) [R¹ is H, a substituted or unsubstituted C₁₋₆ alkyl, etc.; one of Q and T is a group selected from among: and while the other is -Z-Ar (wherein Z is -O-, -S-, etc. and Ar is a substituted or unsubstituted C₆₋₁₀ aryl, etc.), etc.; and R is a substituted or unsubstituted C₃₋₈ cycloalkyl, a substituted or unsubstituted C₆₋₁₀ aryl, etc.]. There are further provided a pharmacologically acceptable salt of the pyrazole derivative, a prodrug thereof and a drug composition containing them. There are still further provided a medical use thereof and a production intermediate therefor.

[続葉有]



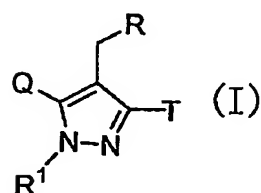
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

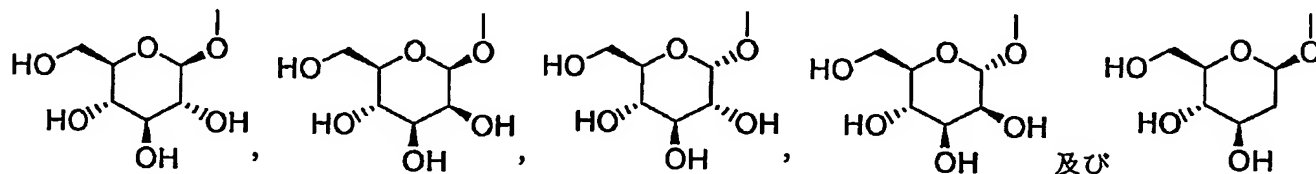
添付公開書類：
— 国際調査報告書

(57) 要約:

本発明は、優れたヒトナトリウム／グルコース共輸送担体（SGLT）阻害作用を発現し、グルコース、フルクトース及びマンノースから選択される少なくとも一つの糖質の過剰取り込みに起因する疾患（糖尿病、食後高血糖、耐糖能異常、糖尿病性合併症等）の予防、進展阻止又は治療薬として有用な、一般式



〔R¹はH、置換可C₁₋₆アルキル等；Q及びTは一方が



から選択される基であり、他方が—Z—A_r（Zは—O—、—S—等；A_rは置換可C₆₋₁₀アリール等）等；Rは置換可C₃₋₈シクロアルキル、置換可C₆₋₁₀アリール等）で表されるピラゾール誘導体及びその薬理学的に許容される塩、並びにそれらのプロドラッグ、並びにそれを含有する医薬組成物、その医薬用途及びその製造中間体を提供するものである。